Rec'd PST/PTO 08 AUG 2005



REC'D 0 3 FEB 2005

WIPO PCT

・ 近世に明子を同際予備超告(特許協力条約第一章

(法第12条、法施行規則第56条) [PCT36条及びPCT規則70]

PCT

(10100%20101)	,,,,,,,	<u></u>			
出願人又は代理人 の書類記号 PCT-0401	今後の手続きについて	は、様式PCT/	I PEA/416を参照	すること 	
国際出願番号 PCT/JP2004/001326	(P. A. 4)	02.2004	優先日 (日.月.年) 10.0		
国際特許分類 (IPC) Int. Cl' CO7D211 3/04, 3/10, 5/00, 3/06, 9/06, 35/00, 17/00,	/26, 491/107, 491/20, 40 3/00, 15/06, 27/16, 1/16	1/12, 221/20, A61K3 5, 9/04, 9/10, 9/12, 1	1/445, 31/438, 31/4439, A 3/12, 3/12, 25/18, 25/24,	61P43/0 (続 ———	0, き有)
出願人 (氏名又は名称) 萬有製薬株式会	社				
1. この報告書は、PCT35条に基づ法施行規則第57条(PCT36条) 2. この国際予備審査報告は、この表紙 3. この報告には次の附属物件も添付さ a	の規定に従い送付する。 を含めて全部で れている。 ページである。 、	5 ペーミニの国際予備審査機施細則第607号における国際出願の開	ジからなる。 関が認めた訂正を含む明 参照) 示の範囲を超えた補正を (電子媒体の種	:含むも 類、数を	のとこの
第Ⅳ欄 発明の単一件	報告の基礎 性又は産業上の利用可能 の欠如 (2) に規定する新規性、 献及び説明 文献 備		予備審査報告の不作成 O利用可能性についての§		れを裏付
国際予備審査の請求書を受理した日 06.09.2004		国際予備審査報告	を作成した日 18.01.2005		
名称及びあて先 日本国特許庁(IPEA/J) 郵便番号100-891 東京都千代田区設が関三丁目	5	•••	木 亜希	4 P	9282
1		電話番号 03-	3581-1101 内	opk リョ	

様式PCT/IPEA/409 (表紙) (2004年1月)

第1欄_	報告の基礎	
i. この	国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか	、国際出願の言語を基礎とした。
	の報告は、	基礎とした。 5。
∟ 2. この ≿差替え	1	: (PCT14条) の規定に基づく命令に応答するために提出され 報告に添付していない。)
X	出願時の国際出願書類	
	第 ページ*、	出願時に提出されたもの 付けで国際予備審査機関が受理したもの 付けで国際予備審査機関が受理したもの
	第 ページ*、	付げで国际ア佣番登機関が文座したもの
	請求の範囲 第 項*、 第 項*、 第 項*、 第 項*、 第 項*、	出願時に提出されたもの PCT19条の規定に基づき補正されたもの 付けで国際予備審査機関が受理したもの 付けで国際予備審査機関が受理したもの
	図面 第 ページ/図、 第 ページ/図*、 第 ページ/図*、	
	配列表又は関連するテーブル 配列表に関する補充欄を参照すること。	
3.	棚正により、下記の書類が削除された。 明細書 第 請求の範囲 第 図面 第 配列表(具体的に記載すること) 配列表に関連するテーブル(具体的に記載	ページ 項 ページ/図 すること)
4.	この報告は、補充欄に示したように、この報告 えてされたものと認められるので、その補正が	に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超 されなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))
	財細魯 第 請求の範囲 第 図面 第 配列表(具体的に記載すること) 配列表に関連するテープル(具体的に記載	ベージ 項 ・ ページ/図 すること)
* 4.	・ に該当する場合、その用紙に "superseded" と記	記入されることがある。

有

 第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2)) に定める見解、 それを裏付ける文献及び説明

 1. 見解

 新規性(N)
 請求の範囲

 2, 3, 10, 11, 17-32

 請求の範囲
 1, 4-9, 12-16

 産業上の利用可能性 (IA)
 請求の範囲 1-32
 有

請求の範囲 2,17-29,32

1, 3-16, 30, 31

請求の範囲

請求の範囲

2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

進歩性(IS)

- 1. WO 03/004027 A1
- 2. WO 01/21169 A1

I. 請求の範囲1, 3-16, 30, 31文献1には、メラニン凝集ホルモン (MCH) 拮抗作用を有する種々の化合物が記載されており、Exmaple 329の化合物は、本願一般式 [I] において、 R^{3*} , R^{3*} 、 R^{4*} , R^{4*} , R^{5*} , R^{5*} , R^{6} , W^{1} 及び W^{2} が水素原子、 Y^{1} , Y^{2} , Y^{3} 及び Y^{4} が置換基を有していてもよいメチレン基、かつ、Arがフェニルである化合物に相当する。

医薬に用いられる化合物の技術分野においては、末端の置換基を改変し、医薬として最適又は好適な化合物を得ることはよく行われていることであるから、Exmaple 329の化合物の末端にあるアルキル基を他のアルキル基に変更したり、アリールであるフェニル基を、文献1に該基と同等の置換基として記載されているヘテロアリールに置換してみることは、当業者であれば容易に成し得たことと認められる。

以上から、本願請求の範囲1, 4-9, 12-16に記載された発明は、文献1により新規性及び進歩性を有さず、そして、本願請求の範囲3, 10, 11, 30及び31に記載された発明は、文献1より進歩性を有しない。

II. 請求の範囲2,17-29,32 文献1及び2には、MCH拮抗作用を有するピペリジン誘導体が記載されているが、文献1及び2のいずれにも、該誘導体が、本願一般式 [I-1] で表される化学構造を有することは記載も示唆もされておらず、また、該化学構造を有する化合物に想到することが当業者にとって自明であったとも認められない。

以上から、本願請求の範囲2,17-29及び32に記載された発明は、文献1 及び2に対して新規性及び進歩性を有する。

第	VI欄 ある種の引用文献			
1.	. ある種の公表された文書(PCT規則7	0. 10)	•	
	出願番号 特許番号	公知日 _(日.月.年)	出願日 (日.月.年)	優先日(有効な優先権の主張) (日.月.年)
	WO 2004/004714 A1 [EX]	15. 01. 2004	03. 07. 2003	03. 07. 2002

2. 杏面による開示以外の開示 (PCT規則70.9)

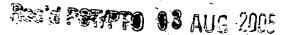
書面による開示以外の開示の種類	書面による開示以外の開示の日付	魯面による開示以外の開示に言及している
HILLON DENIE DO FINA	(日. 月. 年)	

補充概

いずれかの欄の大きさが足りない場合

国際特許分類(IPC)の続き

Int. Cl⁷ A61P25/22, 25/08, 25/28, 25/20, 25/14, 25/30, 25/32, 25/36, 15/00, 15/10, 1/00, 27/00, 25/02, 11/00





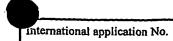
PATENT COOPERATION TR



PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

ۋەلى _{نىد} ق	anslation enternation	ATENT COOPE		Y	PCT/JP2004/00132
L.	AUSIO	PNAL PRELIMINAR (Chapter II of the Pate			JTY
•			66 and Rule 70)		
	Applicant's or agent's file reference PCT-0401	FOR FURTHER AC	rion	See Form PCT/I	PEA/416
	International application No. PCT/JP2004/001326	International filing date 09 February 2004	• •	L .	lay/month/year) ry 2003 (10.02.2003)
	International Patent Classification (IPC) or n C07D211/26,491/107,491/20,40 ,35/00,17/00,3/00,15/06,27/16,1/	1/12,221/20,A61K31/4	145,31/438,31/4439),A61P43/00,3/ 4 (SEE SUP. S	/04,3/10,5/00,3/06,9/06 HEET)
	Applicant BA	NYU PHARMACE	UTICAL CO.,LT	rd.	
	This report is the international prelin Authority under Article 35 and trans	minary examination repo smitted to the applicant a	rt, established by this ecording to Article 36	International Pro	eliminary Examining
	and/or sheets con Administrative In Sheets which sup beyond the discle Supplemental Bob. b. (sent to the Internation readable form only, as in Administrative Instruction Administrative Instruction Sent Sent Sent Sent Sent Sent Sent Sen	ANNEXES, comprising: It to the International Bur cription, claims and/or drataining rectifications aut astructions). It is reseduce earlier sheets, but cosure in the international ox. In a sure only) a terminational ox. In a sure only only or on tail or o	awings which have be horized by this Authority application as filed, total of (indicate tyning a sequence listing ental Box Relating the mas:	sheets, as for seen amended and ority (see Rule 7 yr considers contrast indicated in its type and number and/or tables to Sequence List	d are the basis of this report 0.16 and Section 607 of the ain an amendment that goes item 4 of Box No. I and the ar of electronic carrier(s)) related thereto, in computering (see Section 802 of the
		rvations on the internatio		-Cabia re-est	
	Date of submission of the demand 06 September 2004 (06.	.09.2004)	Date of completion	of this report January 2005	(18.01.2005)
	Name and mailing address of the IPEA/JP		Authorized officer		
	2 1 11 27		Telephone No		

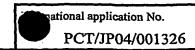


INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

PCT/JP2004/001326

Box No.	I Basis of the report
1. With other	regard to the language, this report is based on the international application in the language in which it was filed, unless wise indicated under this item.
	This report is based on translations from the original language into the following language, which is language of a translation furnished for the purpose of:
	international search (under Rules 12.3 and 23.1(b))
]	publication of the international application (under Rule 12.4)
	international preliminary examination (under Rules 55.2 and/or 55.3)
İ	
furnis	regard to the elements of the international application, this report is based on (replacement sheets which have been shed to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" are not annexed to this report): The international application as originally filed/furnished
	the description:
	pages, as originally filed/furnished
	pages* received by this Authority on
	pages* received by this Authority on
	the claims:
	pages , as originally filed/furnished
	pages*, as amended (together with any statement) under Article 19
	pages* received by this Authority on
1	pages* received by this Authority on
	the drawings:
	Dages
	pages*, as originally mediumshed
1	pages* received by this Authority on
	a sequence listing and/or any related table(s) - see Supplemental Box Relating to Sequence Listing.
-	a sequence nating and or any related table(s) — see supplemental Box Relating to sequence Listing.
3	The amendments have resulted in the cancellation of:
	the description, pages
1	the claims, Nos.
	the drawings, sheets/figs
	the sequence listing (specify):
	any table(s) related to sequence listing (specify):
	•
4.	This report has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).
1	the claims, Nos.
	the drawings, sheets/figs
1	the sequence listing (specify):
1	any table(s) related to sequence listing (specify):
	and another relative to sequence fishing (specify).
* If iten	1 4 applies, some or all of those sheets may be marked "superseded."

INARY REPORT ON PATENTABILITY



Box No. V	Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability;
ì	citations and explanations supporting such statement

tatement Novelty (N)	Claims	2, 3, 10, 11, 17-32	Y1
	Claims	1, 4-9, 12-16	No.
Inventive step (IS)	Claims	2, 17-29, 32	Y
	Claims	1, 3-16, 30, 31	N
Industrial applicability (IA)	Claims	1-32	Y.
	Claims		N

2. Citations and explanations (Rule 70.7)

Document 1: WO, 03-004027, A1 Document 2: WO, 01-21169, A1

I. Claims 1, 3-16, 30 and 31

Document 1 describes various compounds having melanin-concentrating hormone (MCH) antagonism, and the compound of Example 329 corresponds to a compound represented by the general formula [I] of the present application, where R^{3a} , R^{3b} , R^{4a} , R^{4b} , R^{5a} , R^{5b} , R^{6} , W^{1} and W^{2} denote respectively a hydrogen atom; Y^{1} , Y^{2} , Y^{3} and Y^{4} denote respectively a methylene group having or not having a substituent group, and Ar denotes phenyl.

In the technical field of compounds used for drugs, it is often practiced to modify the substituent groups at the ends for obtaining a compound most suitable or suitable as a drug. So, a person skilled in the art could have easily (1) changed the alkyl group at an end of the compound of Example 329 into another alkyl group and (2) substituted a phenyl group as an aryl group by a heteroaryl group described as a substituent group equivalent to the said group in document 1.

From the above, the subject matters of claims 1, 4-9 and 12-16 of the present application do not appear to be novel or to involve an inventive step in view of document 1, and the subject matters of claims 3, 10, 11, 30 and 31 of the present application do not appear to involve an inventive step in view of document 1.

II. Claims 2, 17-29 and 32

Documents 1 and 2 respectively describe a piperidine derivative having MCH antagonism, but neither document 1 nor document 2 describes or suggests that the said derivative has the chemical structure represented by the general formula [I-1] of the present application. Furthermore, it is not considered to be obvious for a person skilled in the art to conceive of compounds having the said chemical structure.

From the above, the subject matters of claims 2, 17-29 and 32 of the present application appear to be novel and to involve an inventive step in view of documents 1 and 2.

INTERNATIONAL PI MINARY REPORT ON PATENTABILITY Box No. VI Certain documents cited 1. Certain published documents (Rule 70.10) Application No. **Publication date** Filing date Priority date (valid claim) Patent No. (day/month/year) (day/month/year) (day/month/year) WO 2004/004714 A1 15.01.2004 03.07.2003 03.07.2002 [E, X]

2. Non-written disclosures (Rule 70.9)		
Kind of non-written disclosure	Date of non-written disclosure (day/month/year)	Date of written disclosure referring to non-written disclosure (day/month/year)

Supp	iemental	Box
------	----------	-----

In case the space in any of the preceding boxes is not sufficient. Continuation of: IPC

Int.Cl7

A61P25/22,25/08,25/28,25/20,25/14,25/30,25/32,25/36,15/00,15/10,1/00,27/00,25/02,11/00

This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning Operations and is not part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

BLACK BORDERS

IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES

FADED TEXT OR DRAWING

BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING

SKEWED/SLANTED IMAGES

COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS

GRAY SCALE DOCUMENTS

LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT

REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

☐ OTHER:

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.